

FRENCH REPUBLIC
MINISTRY OF INDUSTRY

SPECIAL MEDICAMENT PATENT

Filing No. 57.566

No. 5.549 M

DEPARTMENT of
INDUSTRIAL PROPERTY

International Classification:

A 61 k

Laxative medicament

Mr. André ROBERTI, residing in France (Seine)

Applied for on April 14, 1966 at 1:52 p.m. in Paris

Issued via the decree of November 20, 1967

(Official Bulletin of Industrial Property [B.S.M.], No. 52 of December 26, 1967)

The subject of the present invention is a novel laxative medicament that regularizes the functioning of the intestine without [causing drug] dependence or irritation, or any other secondary complication.

The medicament, which forms the subject of the invention, is characterized in that it contains, within an excipient, a synergistic mixture comprising at least one wetting agent, one surfactant, [and/or] one choleric-cholagogue.

The wetting agent can be a silicone, such as dimethylpolysiloxane.

The surfactant can be a quaternary ammonium derivative, or a sulfonic derivative, or a biliary salt, or even one of its derivatives.

The choleric-cholagogue can be an ose [sugar-type compound], such as mannitol, or sorbitol, or even cholic acid, a biliary salt or its derivatives, a magnesium salt, such as the sulfate, or dehydrocaffeic acid.

The excipient can be formed, at least in part, from honey, prune puree, glycerine, water, mucilage, edible oils, aromas, and/or edible dyes.

A medicament in accordance with the invention can also contain at least one phthalic derivative, for example a phthalein such as phenolphthalein, an anthraquinone-type compound such as those from aloe, alder buckthorn, cascara, buckthorn, rhubarb, senna, as well as synthetic phthalic compounds.

The medicament in accordance with invention is suitable, in particular, for treating cases of chronic or occasional constipation, colitis, idiopathic constipation, rectal dyschesia, constipation in pregnant women,

premenstrual constipation, as well as cases of mega [sic; megacolon?], dolichocolon, and intestinal atonia.

The medicaments in accordance with the invention are active in doses that are normally between approximately 1/4 and 2 spoonfuls per day.

The examples below give some data relating to the medicament in accordance with the invention.

Example 1. One starts by preparing a polysiloxane gel by introducing a mixture of 69 parts of water and 1 part of the emulsifier, which is sold under the trade name "Carbopol 934" by the B.F. Goodrich company (vinyl polymer with an active carboxyl group of the carboxypolymethylene type), and 30 parts of a dimethylpolysiloxane such as those sold under the name "Rhodorsil" 1000 or 500 by the Rhône-Poulenc company.

The gel is stabilized by adding decinormal caustic soda solution until the pH of the gel is between 6 and 7.

30 parts of honey (or prune puree) are then added to this mixture, followed by a mixture of one part of sennoside, i.e. senna extract, 5 parts of biliary salts in their aluminate form, and 30 parts of 70% sorbitol.

An edible perfume and an edible dye are added, if desired, as well as water which comprises the balance in order to form a relatively fluid paste.

Example 2. A medicament that contains 20 parts of dimethylpolysiloxane, 20 parts of honey, 50 parts of sorbitol, 1 part of sodium octylsulfonate, 5 parts of the ferrous derivative of biliary salts, sucrose in order to achieve caramelization, as well as edible perfumes and dyes are prepared in the same way as in Example 1. The mixture is churned in such a way as to

BREVET SPÉCIAL DE MÉDICAMENT

P.V. n° 57.566

N° 5.549 M

Classification internationale :

A 61 k

Médicament laxatif.

M. ANDRÉ ROBERTI résidant en France (Seine).

Demandé le 14 avril 1966, à 13^h 52^m, à Paris.

Délivré par arrêté du 20 novembre 1967.

(Bulletin officiel de la Propriété industrielle [B.S.M.], n° 52 du 26 décembre 1967.)

La présente invention a pour objet un nouveau médicament laxatif régularisant la fonction intestinale sans accoutumance ni irritation ou autre complication secondaire.

Le médicament qui fait l'objet de l'invention est caractérisé en ce qu'il renferme, dans un excipient, un mélange synergique d'au moins un mouillant, un tensio-actif, un cholérétique-cholagogue.

Le mouillant peut être une silicone telle que la diméthylpolysiloxane.

Le tensio-actif peut être un dérivé d'ammonium quaternaire ou un dérivé sulfonique ou un sel biliaire ou encore un de ses dérivés.

Le cholérétique-cholagogue peut être un ose tel que la mannite ou le sorbitol ou bien de l'acide cholique, un sel biliaire ou leurs dérivés, un sel de magnésium tel que le sulfate ou l'acide déhydrocافéinique.

L'excipient peut être constitué, au moins en partie, par du miel, de la purée de pruneaux, de la glycérine, de l'eau, des mucilages, des huiles comestibles, des arômes et/ou des colorants alimentaires.

Un médicament suivant l'invention peut renfermer également au moins un dérivé phtalique, par exemple une phtaléine, telle la phénolphtaléine, un anthraquinonique, tels ceux de l'aloès, la bourdaine, le cascara, le nerprum, la rhubarbe, le séné, ainsi que les composés synthétiques phtaliques.

Le médicament suivant l'invention convient plus particulièrement pour le traitement des constipations chroniques ou occasionnelles, des colites, des constipations idiopathiques, des dyschésies rectales, de la constipation de la femme enceinte, de la constipation prémenstruelle, ainsi que dans les cas de méga et dolichocolon et d'atonie intestinale.

Les médicaments suivant l'invention sont actifs à des doses comprises normalement entre environ 1/4 et 2 cuillerées à café par jour.

Les exemples ci-après donnent quelques indications du médicament suivant l'invention.

Exemple 1. — On commence par préparer un gel de polysiloxane en introduisant un mélange de 69 parties d'eau et 1 partie d'émulsionnant vendu

sous la dénomination commerciale de « Carbopol 934 » par la Société dite B. F. Goodrich (polymère vinylique à groupe carboxyle actif du type carboxypolyméthylène), 30 parties de diméthylpolysiloxane, tels ceux vendus sous la dénomination de « Rhodorsil » 1 000 ou 500 par la Société dite Rhône-Poulenc.

On stabilise le gel par addition de soude caustique décinormale jusqu'à ce que le pH du gel soit compris entre 6 et 7.

On ajoute ensuite à ce mélange 30 parties de miel (ou de purée de pruneaux), puis un mélange d'une partie de sénoside, extrait du séné, 5 parties de sels biliaires sous forme d'aluminate et 30 parties de sorbitol à 70 %.

On ajoute à volonté un parfum alimentaire et un colorant alimentaire, ainsi qu'un appoint d'eau pour former une pâte relativement fluide.

Exemple 2. — On prépare de la même façon que dans l'exemple 1 un médicament renfermant 20 parties de diméthylpolysiloxane, 20 parties de miel, 50 parties de sorbitol, 1 partie d'octylsulfonate de sodium, 5 parties de dérivé ferreux de sels biliaires, du sucre pour caraméliser, ainsi que des parfums et colorants alimentaires. On malaxe l'ensemble de façon à obtenir une masse plastique mais ferme que l'on divise en parallélépipèdes rectangles de dimensions et d'aspect analogues à ceux de caramels.

Exemple 3. — Un malade présentant une alternance de diarrhée et de constipation avec douleurs coliques sans que l'examen radiographique mette en évidence une anomalie du colon, est traité par absorption, une fois par jour, d'une cuillerée à café du mélange préparé suivant l'exemple 1. Les troubles disparaissent pratiquement dès le début du traitement.

Exemple 4. — Une malade de 40 ans, souffrant de constipation chronique, utilisant des laxatifs depuis plus de 10 ans, avec complications dues à des irritations, voit ses troubles progressivement diminuer puis disparaître et l'état bénéfique se maintenir par absorption régulière de 2 cuillerées à

obtain a composition which is plastic, but firm, and that is divided into rectangular parallelepipeds with aspect ratios that are analogous to those of caramel.

Example 3. A male patient having alternating diarrhea and constipation with cholic pain, with no anomaly of the colon having been demonstrated via a radiographic examination, is treated by ingesting one teaspoonful, once per day, of the mixture that was prepared in accordance with Example 1. His troubles disappeared virtually as from the start of the treatment.

Example 4. A female patient, who was 40 years of age and who was suffering from chronic constipation and who had been using laxatives for more than 10 years with complications due to irritation, sees her troubles progressively diminish and then disappear, and her beneficial state maintained as a result of the regular ingestion of 2 spoonfuls ... [text not continued]